



Biopharm Scientific Annual
Meeting

OPTIMISATION DE LA FORMULATION D'UN COMPRIMÉ ORODISPERSIBLE EBASTINE 10MG

A.BENAYACHE¹*, L. LAMOUDI¹, K. DAOUD¹

¹Laboratoire des phénomènes de transfert ,Alger, Algérie



Résumé

L'objectif de notre recherche est d'optimiser la composition du générique EBASTINE 10 mg afin d'obtenir une formulation qui offre une libération optimale du principe actif et une désintégration plus rapide proche de celle du princeps KESTIN.

Pour atteindre cet objectif, nous avons utilisé deux méthodes de formulation, la compression directe et la granulation humide en modifiant les diluants et les désintégrants, accompagnées de tests pharmacocinétiques réalisés sur les comprimés.

Nous avons conclu que les résultats obtenus avec la granulation humide sont meilleurs, et que la formulation optimale est F5.

Plusieurs modèles mathématiques sont utilisés pour modéliser les profils de dissolution du générique et du princeps

Mots-clés : EBASTINE, générique, princeps, dissolution, orodispersible, superdésintégrant.

1-INTRODUCTION

Les comprimés orodispersibles jouent un rôle crucial dans la pharmacothérapie moderne en raison de leur facilité d'administration, car ils se dissolvent rapidement dans la bouche sans besoin d'eau. Grâce à leur désintégration rapide [1]. L'objectif de notre recherche est d'optimiser la composition du générique EBASTINE 10 mg afin d'obtenir une formulation qui offre une libération optimale du principe actif et une désintégration plus rapide proche de celle du princeps KESTIN. Pour atteindre cet objectif, nous avons utilisé deux méthodes de formulation, la compression directe et la granulation humide en modifiant les diluants et les désintégrants, accompagnées de tests pharmacocinétiques réalisés sur les comprimés

2-MATÉRIELS ET MÉTHODE

Première méthode : Compression directe

Deuxième méthode : Granulation humide

Test pharmaco technique

Tableau 1 : la compression directe,

Essais	F1	F2	F3	F4	F5
Ingrédients	Poids (mg/Cp)				
Ebastine	10	10	10	10	10
Microcristalline cellulose	55	45	35	43	47
Mannitol	56,5	66,5	76,5	66,5	66,5
Crospovidone	5,2	5,2	5,2	7,2	3,2
Aspartam	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5
Peppermint	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5
Aérosol	2	2	2	2	2
Mg stéarate	1,3	1,3	1,3	1,3	1,3
Poids totale	135	135	135	135	135

Tableau 2:Granulation humide

Essais	F1	F2	F3	F4	F5
Ingrédients	Poids (mg/Cp)				
Ebastine	10	10	10	10	10
Microcristalline cellulose	45	45	43	42	39,8
Mannitol	66,5	0	0	0	0
Lactose monohydrate	0	66,5	66,5	66,5	66,5
Amidon de maïs	0	5,2	7,2	5,2	5,2
Crosscarmellose	0	0	0	3	5,2
Aspartam	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5
Aspartam	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5
Arome menthe-poivrée	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5
Aérosil	2	2	2	2	2
Mg stéarate	1,3	1,3	1,3	1,3	1,3
Crospovidone	5,2	0	0	0	0
Poids totale	135	135	135	135	135



Figure 1 : Désintégrateur

Figure 2 : Dissolutest

Milieu : Eau
distillé a 37C°
Norme : ≤30s

Milieu : 0,1N HCl + 0,5% SLS
Volume : 900ml
Vitesse d'agitation 50tr/min
Norme : ≥85%

3-RÉSULTATS ET DISCUSSION

Compression directe

Granulation humide

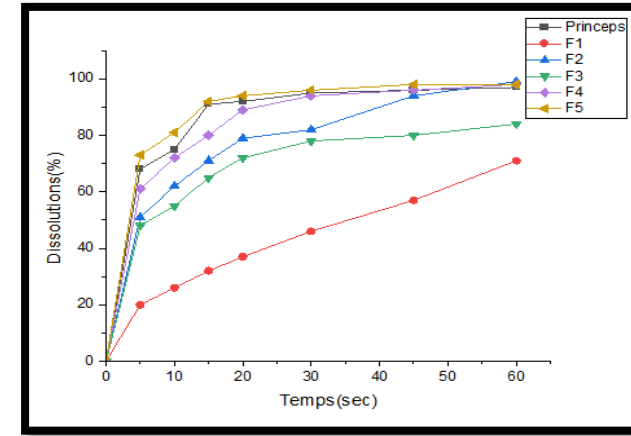
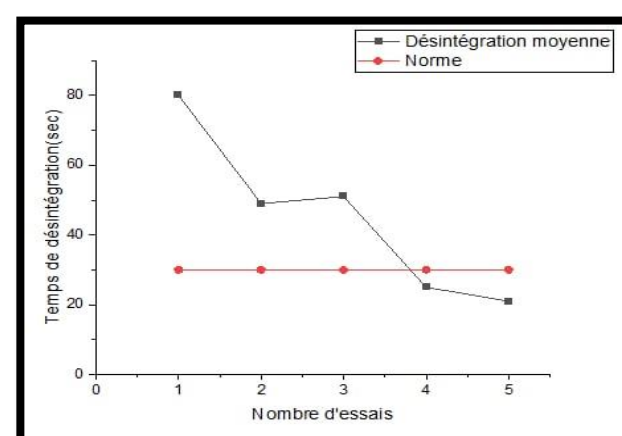
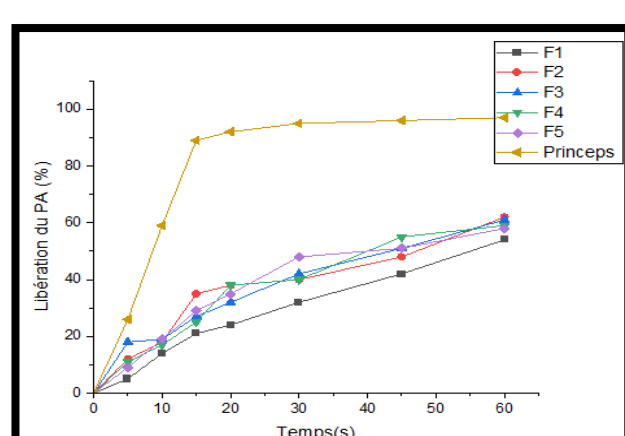
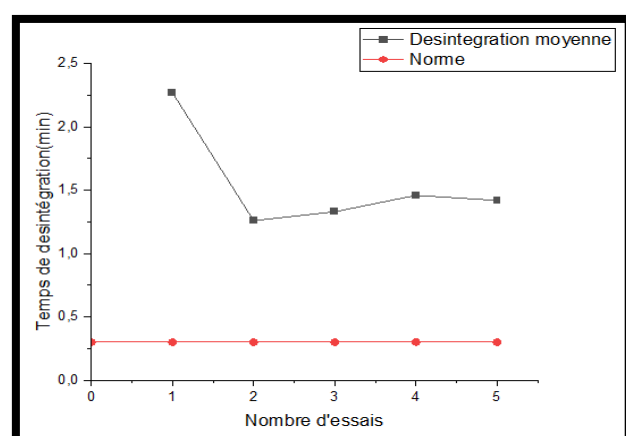


Figure 3 : Temps de désintégration

Figure 4 : Profils de dissolution

Figure 5: Temps de désintégration

Figure 6: Profil de dissolution

4-CONCLUSION

Nous avons utilisé deux méthodes de formulation, la compression directe et la granulation humide, accompagnées de tests pharmacocinétiques réalisé sur les comprimés, cette étude a permis de mettre en évidence l'importance des tests, notamment ceux de désintégration et de dissolution.

À l'issue de plusieurs essais d'optimisation, l'étude conclut que la formulation F5, élaborée par granulation humide, représente la formulation optimale. Elle se distingue par un temps de désintégration plus court et une meilleure performance en dissolution.

Références bibliographiques

[1] V. Sharma, A. Philippe, K. Pathak « Polysaccharides modifiés en tant qu'excipients à désintégration rapide pour les comprimés orodispersibles de roxithromycine ». AAPS PharmSciTech., 9 (1) (2008), p. 1530-9932